特許協力条約

REC'D 2 6	NOV	2004
-----------	-----	------

PCT

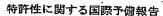
WIPO PCT

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

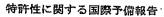
(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 1508	今後の手続きに	ういては、	様式PCT/	IPEA/41	6を参用	照する	こと。
国際出願番号 PCT/JP03/12158	国際出願日 (日.月.年) ²	4.09.	2003	優先日 (日.月.年)	24.	09.	2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D487 25/16, 25/20, 25/24, 25/28, 43/00	7/04, A61K31/519,	31/5377, 3	1/55, 31/553, A6	1P9/00, 9/10, 2	1/00, 25	5/00, 2	5/14,
出願人 (氏名又は名称) 協和醗酵	、 孝工業株式会社				•	-	
1. この報告書は、PCT35条に基づき 法施行規則第57条 (PCT36条) の	さこの国際予備審3 O規定に従い送付す	査機関で作 計る。	成された国際予	で備審査報告で	ある。		
2. この国際予備審査報告は、この表紙を	☆含めて全部で _	7	ページ	からなる。		•	
3. この報告には次の附属物件も添付され a	ιている。 ページでは	、 ある。					
□ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙(PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)							
□ 第 I 禰 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの 国際予備審査機関が認定した差替え用紙							
, [•	
b [] 電子媒体は全部で 配列表に関する補充欄に示すよ ブルを含む。(実施細則第80	うに、コンピュー 2号参照)	−夕読み取	り可能な形式に	(電子媒 よる配列表又に	体の種 は配列表	類、数	を示す)。 車するテー
4. この国際予備審査報告は、次の内容を	含む。	,	•				
区 第 I 欄 国際予備審查報令 第 I 欄 優先権	告の基礎				·	,	
○ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成○ 第Ⅳ欄 発明の単一性の欠如							
▼ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明							
× 第VI欄 ある種の引用文献	~ C 1011/7.1						
第 第 国際出願の不備	1/A			•			•
第四欄、国際出願に対する	2 安日						
	J 思元						
	,						
国際予備審査の請求書を受理した日 23.04.2004		国際予	滞審査報告を作 04.	成した日 11.200	4		
名称及びあて先	•	特許庁	・ 審査官(権限の	ある職員)		4 C	8619
日本国特許庁(IPEA/JP)			Parm		L		
郵便番号100-8915 東京都千代田区韶が関三丁目4番	· 오 문		關政立	•			



国際出願番号 PCT/JP03/1.2158

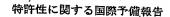
第 I 欄 報告の基礎	
1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほ	か、国際出願の言語を基礎とした。
□ この報告は、	を基礎とした。 ある。 全(PCT14条)の規定に其づく合金に体験される。
× 出願時の国際出願審類	
明細書	
第 ページ、 第 ページ、	出願時に提出されたもの
第 ページ* 第 ページ*	177 日の1個日は成成が文庫したもの
	・ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
請求の範囲 第 項	出願時に提出されたもの
第	・口頭でに近山されたもの ・PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第	付けで国際予備審査機関が受理したもの
7**	
第・ページ/図	LL PS Details and the second of the second o
第ページ/図*、	出願時に提出されたもの
第 ページ/図*、	付けで国際予備審査機関が受理したもの
■ 配列表又は関連するテーブル	
配列表に関する補充欄を参照すること。	
3. 欄 補正により、下記の告類が削除された。	
□ 明細書 第	ページ
頭求の範囲 第	項
□ 図面 第 □ 配列表 (具体的に記載すること)	ページ/図
配列表に関連するテーブル(具体的に記載す	「ること) <u> </u>
4. この報告は、補充欄に示したように、この報告に	一添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超
えてされたものと認められるので、その補正がさ	わなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c))
9 明細書 第	ページ
請求の範囲 第	項
配列表(具体的に記載すること)	ページ/図
□ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載す	ること)
	•
* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記え	入されることがある。
	,



国際出願番号 PCT/JP03/12158

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由によ 審査しない。
国際出願全体
※ 請求の範囲
理由: 区
X この国際出願又は請求の範囲34-37は、国際予備審査をすることを要しない 次の事項を内容としている(具体的に記載すること)。
人の治療方法に係る発明である。
明細書、請求の範囲若しくは図面(次に示す部分)又は請求の範囲 記載が、不明確であるため、見解を示すことができない(具体的に記載すること)。
(具体的に記載すること)。
全部の請求の範囲又は請求の範囲 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。 が、明細書による十分な
× 請求の範囲 34-37 について、国際調査報告が作成されていない。
■ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属 魯C (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細 ��の作成のためのガイドライン)に定める基準を、次の点で満たしていない。
* ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・
コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が
コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属各 Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。
□ 提出されていない。 □ 所定の技術的な要件を満たしていない。
詳細については補充欄を参照すること。

1711年におり、も国際1、開致日	当院出願番号	PCT/JP03/12158 .
発明の単一性の欠如		
請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人	しは、	
請求の範囲を減縮した。		
追加手数料を納付した。		•
]追加手数料の納付と共に異議を申立てた。		
] 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。		•
] 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を認 に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人にす	またしていない さめないことと	と判断したが、PCT規則68.1の規) した。
国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する	· 発明の単一性	を次のように判断する。
満足する。		
以下の理由により満足しない。		·
を有する点で共通の構造を有するものであるいことは、後記文献1、2、5、6の記載かしたがって、請求の節囲第1項に記載の化	ロートのよが、	ーc」ピリミジン部分 こうな構造に新規性がな である。
的な関係があり、単一の一般的発明概念を形することはできない。	成するよう	に関連しているものと
*3 同じく、「3)」、「4)」及び「5) る発明	現定 される	化合物に係る窓田
*5 同じく、「9)」として規定される化*6 同じく、「10)」として規定される化	合物に係る	発明 マ 発明
の七発明を構成するものと認める。 そして、請求の範囲第1項を引用する同第 の*1~*7に対応した七発明を構成する。	2項~第3	3項についても、上記
	•	•
	٠	
·	•	
たがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。		
すべての部分	•	·
請求の範囲 _ 請求の範囲1,2,22-33のうち一般式(I)のR。が1)で定	義される化合物	に係る発明 に関する部分
	発明の単一性の欠如 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出層が 請求の範囲を減縮した。 追加手数料を納付した。 追加手数料を納付と共に異議を申立てた。 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。 国際予備審查機関は、次の理由により発明の単一性の要件を消費を でだい、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出層人にず 満足する。 以下の理由により満足しない。 一に変更の一般式(、41)、13.2及び13.3に規定する。 満足する。 以下の理由により満足しない。 一に変更の一般式(、41)、10、ででリでも載した。 がよい。 一に変更を表したがより、ででリでも取れででである。 ででは、11、13.2及び13.3に規定する。 がより、一般では、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に規定する。 は、11、13.2及び13.3に記載のかと、 は、11、13.2及び13.3に記載のかの記載のの記載のかと、 は、11、13、13.2及び13.3に記載のかの記載のの記載のかの記載のの記載のの記載のの記載のの記載の記載の記載の記載の記載の記載の記述の記載の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の記述の	選明の単一性の欠知 請求の範囲の滅縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、 請求の範囲を滅縮した。 追加手数料を納付した。 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。 請求の範囲の滅縮及び追加手数料の納付もしなかった。 国際予備審查機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないとと 国際予備審查機関は、及の理由により発明の単一性の要件を満たしていないとと 国際予備審查機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性: 減足する。 以下の理由により満足しない。 一(1) で示さアンがのよれる「(1) で示さアンがので、ででリンががのがらよてがでいて、を記します。 にでの理由により満足しない。 一(1) ででいてあるから合いで、はの記載の化て、に記しまり、第1項の一般式(4)のの記載の化て、でりで記載の化て、定記で記載の化て、定記で、記述言述を表すらに記述のであるから合いましたのよびので、でで、で、でにないます。でで、では、では、では、では、では、では、では、では、では、では、では、では、で



国際出願番号 PCT/JP03/12158

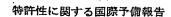
L . 見解 · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		· ,
, 新規性 (N)	請求の範囲 <u>22-33</u> 請求の範囲 <u>1,2</u>	
進歩性 (IS)	請求の範囲 請求の範囲 1,2,22-3	3
産業上の利用可能性(I A)	請求の範囲 1,2,22-3 請求の範囲	33
・ 文献及び説明(PCT規則		
文献 1 : BROWN, D. J simple der 52 (1980) 文献 2 : WO 95/0380 文献 3 : EP 459702 文献 4 : EP 515107 文献 5 : WO 98/4271 文献 6 : WO 00/1720 文献 7 : JP 2000-50 文献 8 : JP 2002-51	.,他,"Bis-s-triazolo[1,5-a:1',5'-c]pyrinivatives",Australian Journal of Chemistr 6 Al Al Al 1 Al 1 Al 2723 A 3382 A	ry, 33(5) pp1147-
文献 1:BROWN, D.J simple der 52 (1980) 文献 2:W0 95/0380 文献 3:EP 459702 文献 4:EP 515107 文献 5:W0 98/4271 文献 6:W0 00/1720 文献 7:JP 2000-50 文献 8:JP 2002-51	.,他,"Bis-s-triazolo[1,5-a:1',5'-c]pyrinivatives",Australian Journal of Chemiston 6 Al Al Al 1 Al 1 Al 2723 A	ry, 33(5) pp1147- fする化合物が記載

記載の発明とは、前者は [1, 2, 4] ートリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン誘導体に係るものであるのに対し、後者は [1, 2, 4] ートリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン誘 a] ー1, 3, 5ートリアジン誘導体に係るものである点において相違する。しか 医薬品の制造にないて 1 2 5ートリアジンで満生力の常志原子をした a」 1, 3, 5 - トックンの受性にはるものにある点において円壁する。しかし、医薬品の製造において、1, 3, 5 - トリアジン誘導体中の窒素原子を炭素原子に置換してピリミジン誘導体とすることは当業者によく知られた技術的手段であるから(必要ならば、文献7, 8を参照)、文献2に記載の1, 3, 5 - トリアジン誘導体中の窒素原子を炭素原子に置換してピリミジン誘導体とすることは当業者

が容易に想到する。

よって、本願請求の範囲1,2,22-26,28,29,31に記載の発明 は、文献2に記載の発明から進歩性を有しない。 3)文献3、4には、式(I)で表される化合物がアデノシン拮抗作用を有し、

虚血性心疾患や脳疾患等の治療に有効であることが記載されている。 本願請求の範囲1,2,22-33に記載の発明と文献3,4に記載の発明とは、前者は[1,2,4]-トリアゾロ[1,5-c]ピリミジン誘導体に係るものであるのに対し、後者は[1,2,4]-トリアゾロ[1,5-a]-1,3,10では、上部(2)ト同様である いては、上記 (2) と同様である。 よって、本願請求の範囲1,2,22-33に記載の発明は、文献3又は4に記



国際出願番号 PCT/JP03/12158

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	、 公知日 _(日.月.年)	出願日 _(日.月.年)	優先日(有効な優先権の主張) (日.月.年)
WO 03/68776 A1 [EX]	21. 08. 2003	14. 02. 2003	15. 02. 2002

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

 書面による開示以外の開示の租類
 書面による開示以外の開示の日付
 書面による開示以外の開示に言及している

 (日.月.年)
 書面の日付(日.月.年)



補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

載の発明から進歩性を有しない。

(4) 文献 5, 6には、アデノシン A_{2A} 受容体拮抗作用を有し、アデノシン A_{2A} 受容体の機能亢進に由来する疾患の治療・予防に有用な[1, 2, 4]ートリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン誘導体が記載されている。

本願請求の範囲1, 2, 22-33に記載の発明は、一般式(I)における基 R^3 の点において、文献5, 6に記載の発明と異なるものと認められる。しかし、文献5においても上記 R^3 に相当する基として各種の置換基が挙げられており、これは、上記 R^3 に相当する基が様々な置換基を採り得ることを示唆するものである。してみると、文献5, 6に記載の発明において、上記 R^3 基に相当する基を本願請求の範囲に記載の周知の基に変えることは当業者が容易に想到する。

よって、請求の範囲1,2,22-33に記載の発明は、文献5又は6に記載の発明から進歩性を有しない。